

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
14. Juli 2005 (14.07.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/063277 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 38/15,  
31/395, C07K 11/02, C07D 273/00, A61P 33/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/013896

(22) Internationales Anmeldedatum:  
7. Dezember 2004 (07.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
10359798.0 19. Dezember 2003 (19.12.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Lev-  
erkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): JESCHKE, Peter  
[DE/DE]; Kalmüntener Str. 44a, 51467 Bergisch Glad-  
bach (DE). HARDER, Achim [DE/DE]; Europaring 54,  
51109 Köln (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG;  
Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen  
(DE).

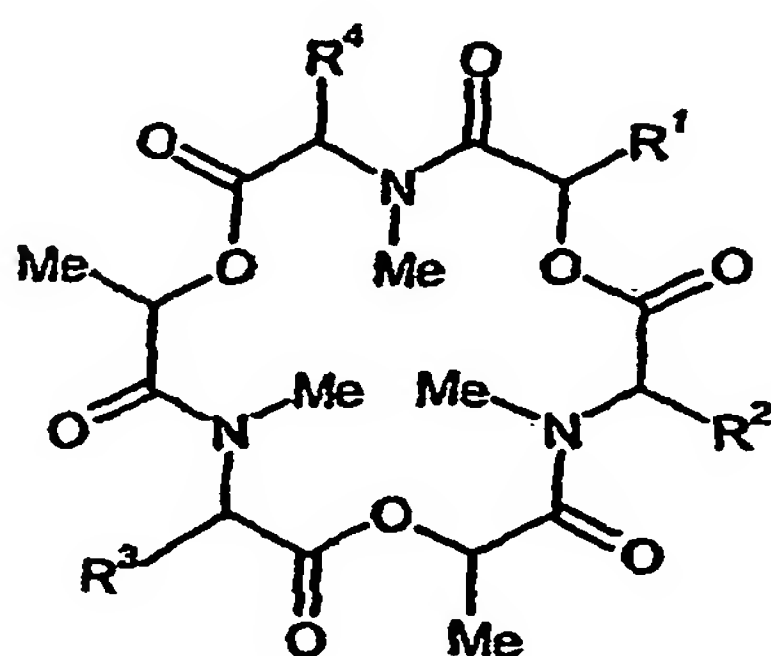
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,  
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,  
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,  
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,  
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 18-MEMBERED NITROBENZYL-SUBSTITUTED AND AMINOBENZYL-SUBSTITUTED CYCLOHEXADEP-  
SIPEPTIDES FOR CONTROLLING ENDOPARASITES, AND METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF

(54) Bezeichnung: 18 GLIEDRIGE NITROBENZYL-UND AMINOBENZYL-SUBSTITUIERTE CYCLOHEXADEPSIPEP-  
TIDE ZUR BEKÄMPFUNG VON ENDOPARASITEN UND EIN VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG



(I)

(57) Abstract: The invention relates to cyclic depsipeptides, especially 18-membered cyclohexadepsipeptides of general formula (I) and the salts thereof, wherein R<sup>1</sup> represents nitrobenzyl or R'R''N-benzyl - wherein R' and R'' independently represent hydrogen, optionally substituted C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxycarbonyl, or hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl-sulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl, or, together with the nitrogen atom to which they are bound, R' and R'' form an optionally substituted monocyclic or polycyclic, optionally bridged and/or spirocyclic, saturated or unsaturated heterocycle containing between one and three other heteroatoms from the group of nitrogen, oxygen and sulphur, or R' and R'' together form C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-alkylene monocarbonyl or an optionally substituted diacyl radical of a C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-dicarboxylic acid - and R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> independently represent C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl. The invention also relates to the

optical isomers and racemates of said cyclic depsipeptides, to a method for the production thereof, and to the use of the same for controlling endoparasites.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft cyclische Depsipeptide, insbesondere 18-gliedrige Cyclohexadepsipeptide, der allgemeinen Formel (I) und deren Salze, in welcher R<sup>1</sup> für Nitrobenzyl oder R'R''N-Benzyl steht, worin R' und R'' unabhängig voneinander jeweils Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl-sulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl bedeuten oder R' und R'' gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten mono- oder polycyclischen, gegebenenfalls überbrückten und/oder spirocyclischen, gegebenenfalls überbrückten und/oder spirocyclischen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclen bilden, der ein bis drei weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthält, oder R' und R'' gemeinsam C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylenmonocarbonyl oder einen gegebenenfalls substituierten Diacylrest einer C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Dicarbonsäure bilden, und R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> unabhängig voneinander für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl stehen, sowie deren optische Isomere und Racemate, ein Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Endoparasiten.

WO 2005/063277 A1



PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*